



ESPAÑA

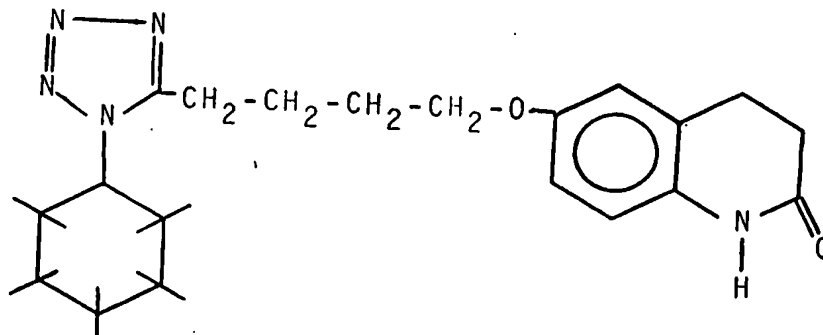
PATENTE DE INVENCION

8702401

<p>90 PRIORIDADES: 91 NUMERO</p>		<p>92 FECHA</p>		<p>93 PAIS</p>	
<p>CADUCADO</p> <p>OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARC Dpto. SECRETARIA GENERAL REPROGRAFIA Benavente, Madrid</p>					
<p>47 FECHA DE PUBLICIDAD</p>		<p>51 CLASIFICACION INTERNACIONAL</p>		<p>52 PATENTE DE LA QUE ES DIVISIONARIA</p>	
<p>54 TITULO DE LA INVENCION</p> <p>"PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE UN DERIVADO DE TETRAZOL".</p> <p>Int. Cl.⁴ C07D 401/12, 215/58, 257/04</p>					
<p>71 SOLICITANTE (ES)</p> <p>LABORATORIO FARMACEUTICO QUIMICO LAFARQUIM, S.A.</p>					
<p>DOMICILIO DEL SOLICITANTE</p> <p>Avda. de Aragón, 18 28027 MADRID</p>					
<p>72 INVENTOR (ES)</p> <p>1.- D. Miguel Izquierdo Sanjosé y 2.- D. Ulpiano Martín Escudero, que han cedido sus derechos a la Solicitante.</p>					
<p>73 TITULAR (ES)</p>					
<p>74 REPRESENTANTE</p> <p>D. FRANCISCO GARCIA CABRERIZO Ref.: O.G. 42.696/PP</p>					

El objeto de la presente invención es un procedimiento de obtención de un derivado de tetrazol, concretamente 6-[4-(1-ciclohexil-5-tetrazolil)butoxi]-1,2,3,4-tetrahidro-2-oxoquinolina, de fórmula:

5.



10.

El producto es un potente y bien tolerado antiagregante plaquetar y antitrombótico con un efecto adicional de vasodilatación periférica.

15.

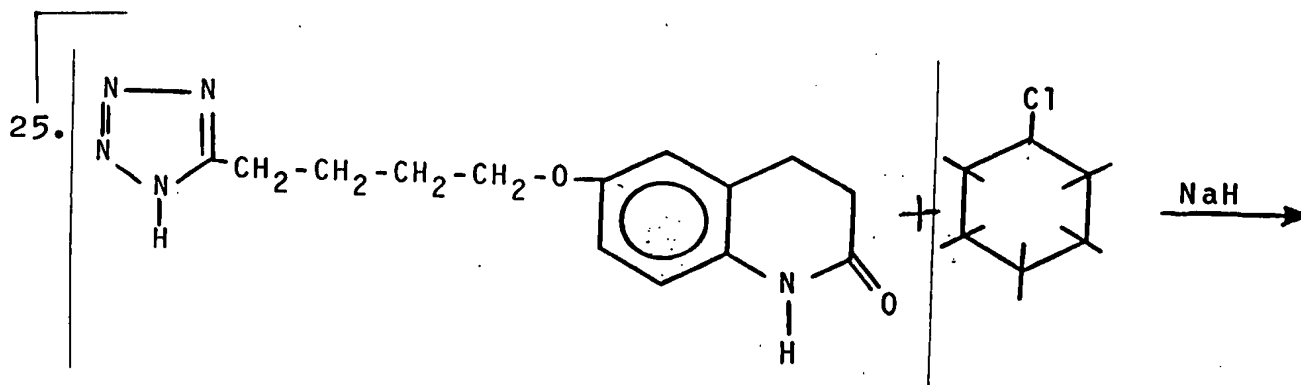
Tanto en perro como en hombre, el producto se absorbe muy bien por vía oral alcanzando altas concentraciones plasmáticas con una vida media de 19-25 horas en el hombre.

La DL_{50} en roedores es superior a 5000 mg/kg

20. (oral).

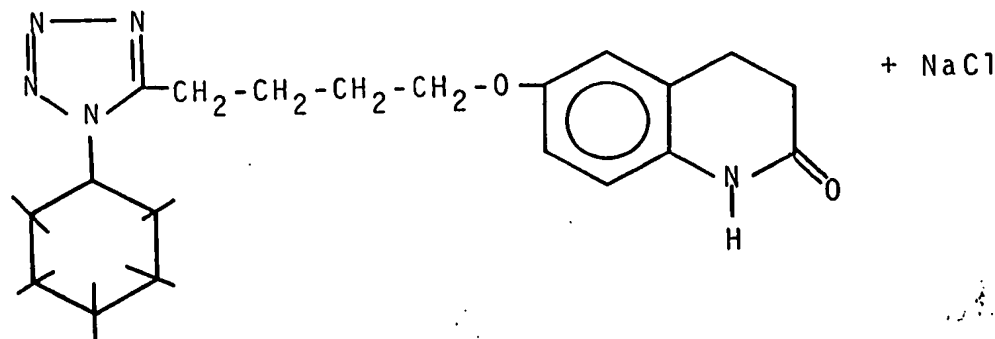
El proceso de obtención transcurre según el esquema:

ma:



30.

5.



10. A continuación damos un ejemplo del procedimiento a título ilustrativo, no limitativo.

Ejemplo 6.099

Una mezcla de 28,5 g. de 6-[4-(5-tetrazolil)butoxi]-1,2,3,4-tetrahidro-2-oxo-quinolina y 2,5 g. de hidruro sódico, se agita en atmósfera de nitrógeno en 300 ml. de tolueno durante 1 hora. Sobre la masa de reacción se añaden 15 g. de cloruro de ciclohexilo. La mezcla se agita a unos 100° durante 8 horas. Se filtra a vacío en caliente, para eliminar el cloruro sódico y la solución se deja cristalizar.

El producto obtenido, blanco, cristalino, pesa unos 20 g. y funde a 159-161°C.

La Solicitante se reserva el derecho de introducir en la presente invención cuantos perfeccionamientos sobre la misma puedan derivarse, mediante la solicitud de los correspondientes Certificados de Adición en la forma señalada por la Ley.

Igualmente, la Solicitante se reserva el derecho de extender esta demanda a los países extranjeros, reivindicando la misma prioridad de la presente solicitud, al ampa-

ro del Convenio Internacional para la protección de la Propiedad Industrial.

N O T A

La Patente de Invención que se solicita por veinte años para España, de acuerdo con la vigente Legislación, deberá recaer sobre: "PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE UN DERIVADO DE TETRAZOL", según las características esenciales de las siguientes:

10.

15.

20.

25.

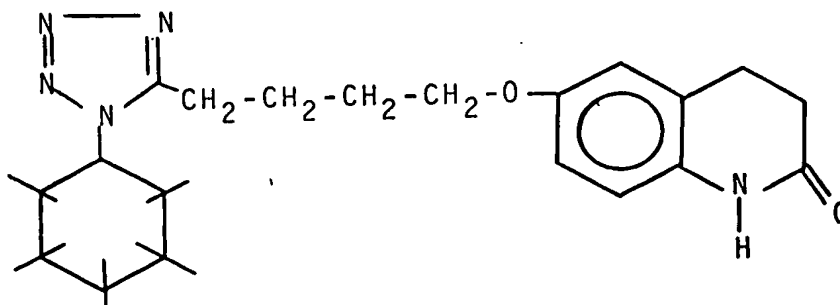
30.

.../...

REIVINDICACIONES

1.- Procedimiento de obtención de un derivado de tetrazol de fórmula:

5.



10.

caracterizado porque los productos reaccionantes son 6-[4-(5-tetrazolil)butoxi]-1,2,3,4-tetrahidro-2-oxo quinolina y haluro de ciclohexilo de preferencia cloruro de ciclohexilo,

15. en presencia de un hidruro alcalino, tal como hidruro sódico, en medio de reacción hidrocarburo aromático de preferencia tolueno, temperatura de reacción desde ambiente a la temperatura de ebullición del disolvente y tiempos de reacción que oscilan entre 1 y 24 horas, obteniéndose como producto de reacción 6-[4-(1-ciclohexil-5-tetrazolil)butoxi]-1,2,3,4-tetrahidro-2-oxo quinolina.

20.

2.- "PROCEDIMIENTO DE OBTENCION DE UN DERIVADO DE TETRAZOL".

Según queda sustancialmente descrito en la presen

25.

.../...

te Memoria que consta de cinco hojas, escritas a máquina --
por una sola cara.

Madrid, 26 DIC. 1985 !

LABORATORIO FARMACEUTICO QUIMICO LAFARQUIM, S.A.
P.P.

5.

FRANCISCO GARCIA CABRERIZO
P. P.

Francisco García del Santo

Firmado: P. García del Santo Cabrerizo

FIG. 1

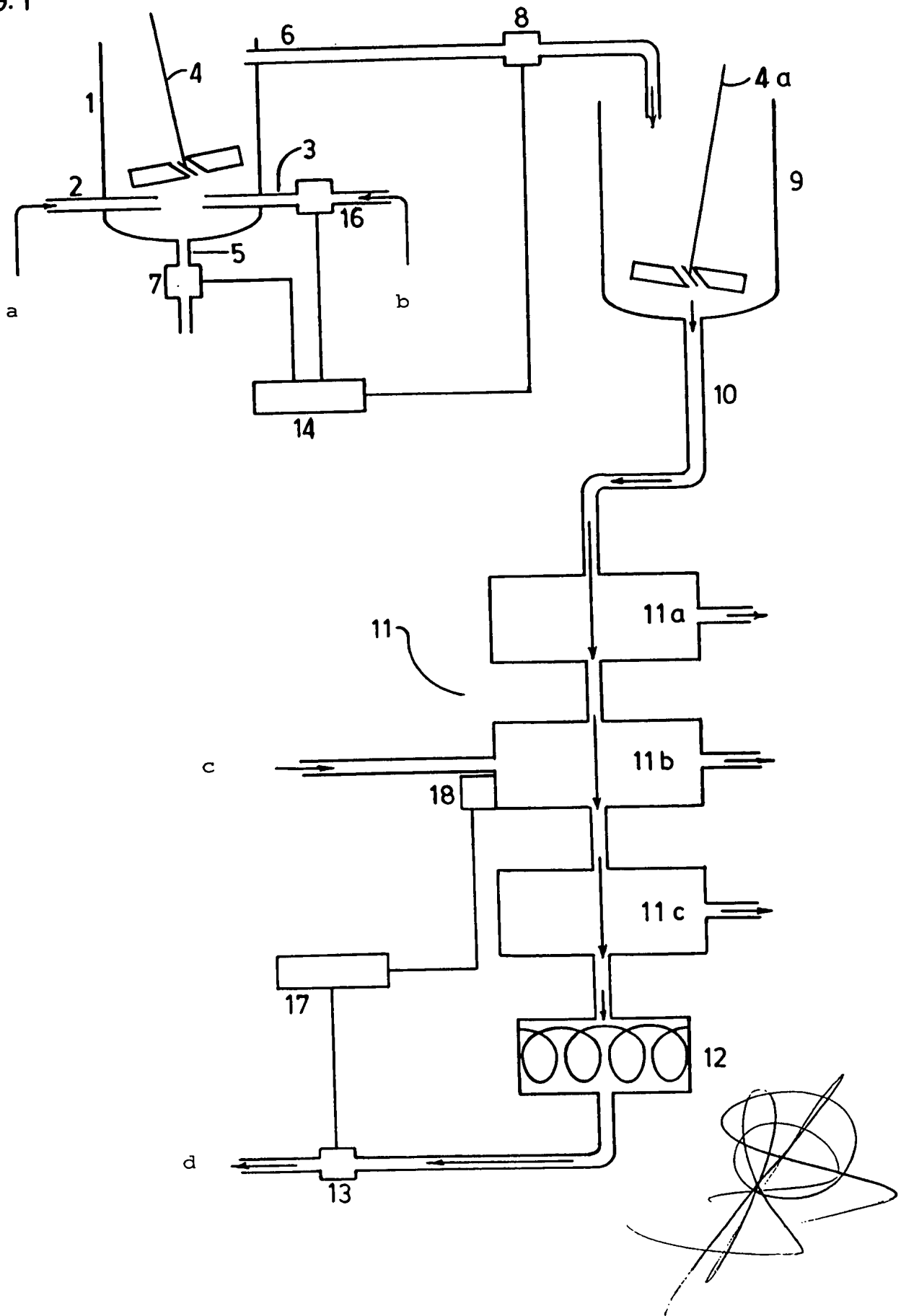


FIG. 2

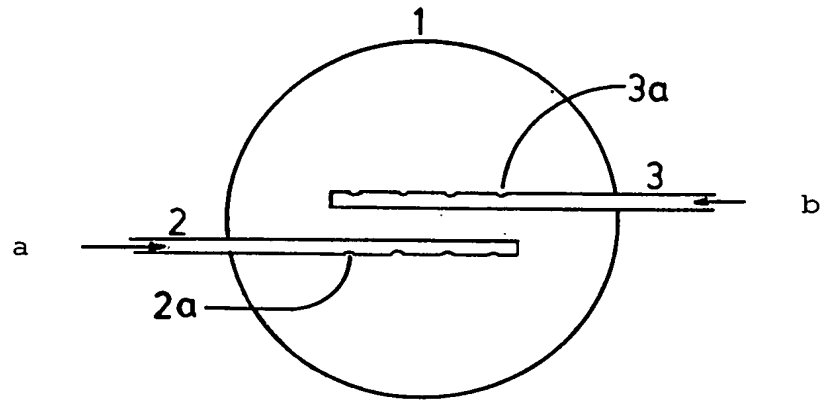


FIG. 3

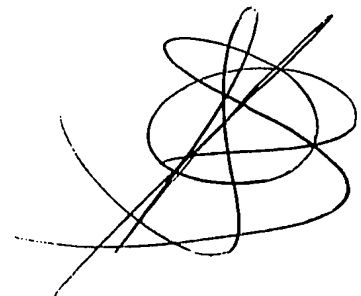
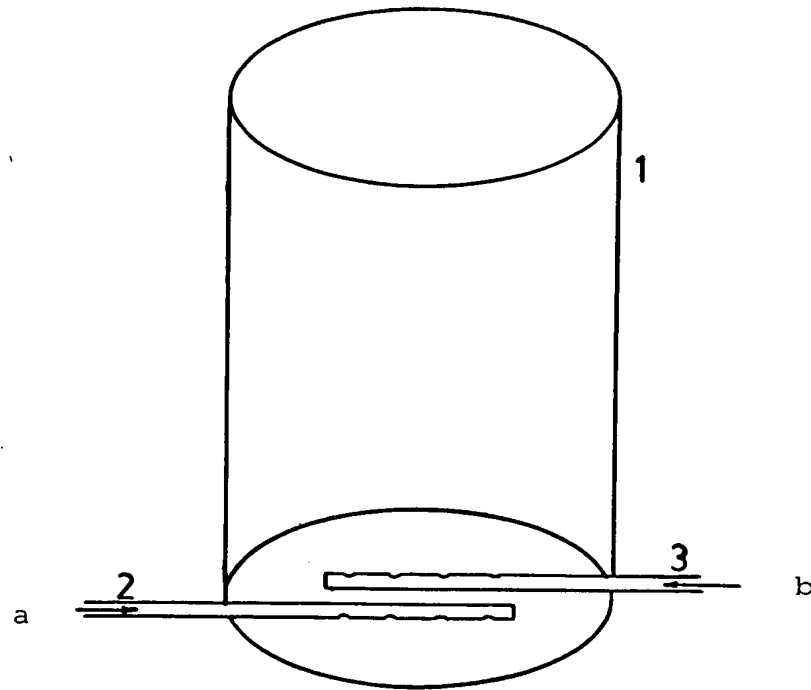


FIG. 4

